

**IMIDAZOQUINOLINES****Publication number:** JP53050197 (A)**Also published as:****Publication date:** 1978-05-08

JP60016438 (B)

**Inventor(s):** NAKA YOICHI; OKUMOTO TAKEKI; HOSOYA SHINKOU; YUKI [JP] HIROSHI +

JP1292402 (C)

**Applicant(s):** YOSHITOMI PHARMACEUTICAL +**Classification:****- International:** A61K31/47; A61P31/04; A61P35/00; A61P35/02; C07D471/04;  
A61K31/47; A61P31/00; A61P35/00; C07D471/00; (IPC1-  
7); A61K31/47; C07D471/04**- European:****Application number:** JP19760123626 19761014**Priority number(s):** JP19760123626 19761014**Abstract of JP 53050197 (A)**

PURPOSE: Imidazoquinoline derivatives of formula I [R<1> and R<2> are H, lower alkyl or aralkyl; R<3> is H, alkyl, lower alkenyl, lower alkoxyalkyl, aralkyl, etc.; Z is OH, hydroxyamino or -OR<4>(R<4> is lower alkyl, lower alkenyl, aryl, etc.)] and their pharmacological acceptable salts, e.g. 1, 3-dimethyl-1, 2, 5, 8-tetrahydro-2, 8dioxoimidazo [4,5-g] quinoline-7-carboxylic acid ethylester.

Data supplied from the **espacenet** database — Worldwide

## 公開特許公報

昭53-50197

⑤Int. Cl.<sup>2</sup> 識別記号  
 C 07 D 471/04 //  
 A 61 K 31/47 ADU  
 ADZ  
 (C 07 D 471/04  
 C 07 D 221/00  
 C 07 D 235/00)

⑥日本分類 厅内整理番号  
 16 E 622 6736-44  
 30 G 133.32 6617-44  
 30 H 52 5727-44  
 30 H 612 5727-44

⑦公開 昭和53年(1978)5月8日  
 発明の数 1  
 審査請求 未請求

(全15頁)

## ⑧イミダゾキノリン誘導体

9 アトマ・ホーン501号

⑨特 願 昭51-123626

⑩発明者 細谷真弘

⑪出 願 昭51(1976)10月14日

福岡県築上郡吉富町大字広津13

⑫発明者 中洋一

36

同 湯木弘

福岡県築上郡吉富町大字広津13

中津市大字湯屋297番地

36

⑬出 願人 吉富製薬株式会社

奥本武城

大阪市東区平野町3丁目35番地

東京都新宿区高田馬場4-31-

⑭代理人 弁理士 高宮城勝

## 明細書

る基を示す。

## 1. 発明の名称

-Zは水素基、ヒドロキシアミノ基または-OR<sup>4</sup>

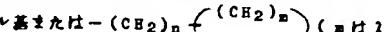
イミダゾキノリン誘導体

基[ R<sup>4</sup> ]は低級アルキル基、低級アルケニル基、

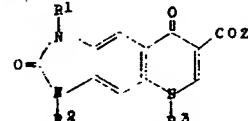
## 2. 特許請求の範囲

低級アルコキシアルキル基、アリール基、アラル

## 1. 一般式

キル基または-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-

(nは2～5の整数を、0は0または1～4の整数を示す。)

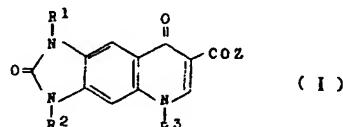


で表わされるイミダゾキノリン誘導体およびその

医薬的に許容しうる塩。

## 3. 発明の詳細な説明

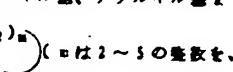
本発明は、一般式



で表わされるイミダゾキノリン誘導体またはその医薬的に許容しうる塩に関する。

上記式中の各記号の定義は、次の通りである。

R<sup>1</sup> , R<sup>2</sup>はそれぞれ水素原子、低級アルキル基またはアカルキル基を示す。

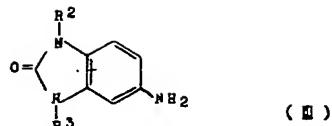
R<sup>3</sup>は水素原子、アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシアルキル基、アラルキル基または-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-

(nは0かおよび1～4の整数を示す。)で表わされ

R<sup>1</sup> , R<sup>2</sup>はそれぞれ水素原子、低級アルキル

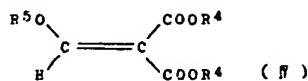
基またはアラルキル基を示す。

R<sup>3</sup>は水素原子、アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシアルキル基、アラルキル基または-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-<img alt="Chemical structure fragment showing a chain of n-1 CH2 groups followed by an oxygen atom." data-bbox="340 145 480 175/200/230/260/290/320/350/380/410/440/470/500/530/560/590/620/650/680/710/740/770/800/830/860/890/920/950/980/1010/1040/1070/1100/1130/1160/1190/1220/1250/1280/1310/1340/1370/1400/1430/1460/1490/1520/1550/1580/1610/1640/1670/1700/1730/1760/1790/1820/1850/1880/1910/1940/1970/2000/2030/2060/2090/2120/2150/2180/2210/2240/2270/2300/2330/2360/2390/2420/2450/2480/2510/2540/2570/2600/2630/2660/2690/2720/2750/2780/2810/2840/2870/2900/2930/2960/2990/3020/3050/3080/3110/3140/3170/3200/3230/3260/3290/3320/3350/3380/3410/3440/3470/3500/3530/3560/3590/3620/3650/3680/3710/3740/3770/3800/3830/3860/3890/3920/3950/3980/4010/4040/4070/4100/4130/4160/4190/4220/4250/4280/4310/4340/4370/4400/4430/4460/4490/4520/4550/4580/4610/4640/4670/4700/4730/4760/4790/4820/4850/4880/4910/4940/4970/4990/5020/5050/5080/5110/5140/5170/5200/5230/5260/5290/5320/5350/5380/5410/5440/5470/5500/5530/5560/5590/5620/5650/5680/5710/5740/5770/5800/5830/5860/5890/5920/5950/5980/5000/5030/5060/5090/5120/5150/5180/5210/5240/5270/5300/5330/5360/5390/5420/5450/5480/5510/5540/5570/5600/5630/5660/5690/5720/5750/5780/5810/5840/5870/5900/5930/5960/5990/6020/6050/6080/6110/6140/6170/6200/6230/6260/6290/6320/6350/6380/6410/6440/6470/6500/6530/6560/6590/6620/6650/6680/6710/6740/6770/6800/6830/6860/6890/6920/6950/6980/7010/7040/7070/7100/7130/7160/7190/7220/7250/7280/7310/7340/7370/7400/7430/7460/7490/7520/7550/7580/7610/7640/7670/7700/7730/7760/7790/7820/7850/7880/7910/7940/7970/7000/7030/7060/7090/7120/7150/7180/7210/7240/7270/7300/7330/7360/7390/7420/7450/7480/7510/7540/7570/7600/7630/7660/7690/7720/7750/7780/7810/7840/7870/7900/7930/7960/7990/8020/8050/8080/8110/8140/8170/8200/8230/8260/8290/8320/8350/8380/8410/8440/8470/8500/8530/8560/8590/8620/8650/8680/8710/8740/8770/8800/8830/8860/8890/8920/8950/8980/9010/9040/9070/9100/9130/9160/9190/9220/9250/9280/9310/9340/9370/9400/9430/9460/9490/9520/9550/9580/9610/9640/9670/9700/9730/9760/9790/9820/9850/9880/9910/9940/9970/9990/10000/10030/10060/10090/10120/10150/10180/10210/10240/10270/10300/10330/10360/10390/10420/10450/10480/10510/10540/10570/10600/10630/10660/10690/10720/10750/10780/10810/10840/10870/10900/10930/10960/10990/11020/11050/11080/11110/11140/11170/11200/11230/11260/11290/11320/11350/11380/11410/11440/11470/11500/11530/11560/11590/11620/11650/11680/11710/11740/11770/11800/11830/11860/11890/11920/11950/11980/12010/12040/12070/12100/12130/12160/12190/12220/12250/12280/12310/12340/12370/12400/12430/12460/12490/12520/12550/12580/12610/12640/12670/12700/12730/12760/12790/12820/12850/12880/12910/12940/12970/12990/13020/13050/13080/13110/13140/13170/13200/13230/13260/13290/13320/13350/13380/13410/13440/13470/13500/13530/13560/13590/13620/13650/13680/13710/13740/13770/13800/13830/13860/13890/13920/13950/13980/14010/14040/14070/14100/14130/14160/14190/14220/14250/14280/14310/14340/14370/14400/14430/14460/14490/14520/14550/14580/14610/14640/14670/14700/14730/14760/14790/14820/14850/14880/14910/14940/14970/14990/15020/15050/15080/15110/15140/15170/15200/15230/15260/15290/15320/15350/15380/15410/15440/15470/15500/15530/15560/15590/15620/15650/15680/15710/15740/15770/15800/15830/15860/15890/15920/15950/15980/16010/16040/16070/16100/16130/16160/16190/16220/16250/16280/16310/16340/16370/16400/16430/16460/16490/16520/16550/16580/16610/16640/16670/16700/16730/16760/16790/16820/16850/16880/16910/16940/16970/16990/17020/17050/17080/17110/17140/17170/17200/17230/17260/17290/17320/17350/17380/17410/17440/17470/17500/17530/17560/17590/17620/17650/17680/17710/17740/17770/17800/17830/17860/17890/17920/17950/17980/18010/18040/18070/18100/18130/18160/18190/18220/18250/18280/18310/18340/18370/18400/18430/18460/18490/18520/18550/18580/18610/18640/18670/18700/18730/18760/18790/18820/18850/18880/18910/18940/18970/18990/19020/19050/19080/19110/19140/19170/19200/19230/19260/19290/19320/19350/19380/19410/19440/19470/19500/19530/19560/19590/19620/19650/19680/19710/19740/19770/19800/19830/19860/19890/19920/19950/19980/20010/20040/20070/20100/20130/20160/20190/20220/20250/20280/20310/20340/20370/20400/20430/20460/20490/20520/20550/20580/20610/20640/20670/20700/20730/20760/20790/20820/20850/20880/20910/20940/20970/20990/21020/21050/21080/21110/21140/21170/21200/21230/21260/21290/21320/21350/21380/21410/21440/21470/21500/21530/21560/21590/21620/21650/21680/21710/21740/21770/21800/21830/21860/21890/21920/21950/21980/22010/22040/22070/22100/22130/22160/22190/22220/22250/22280/22310/22340/22370/22400/22430/22460/22490/22520/22550/22580/22610/22640/22670/22700/22730/22760/22790/22820/22850/22880/22910/22940/22970/22990/23020/23050/23080/23110/23140/23170/23200/23230/23260/23290/23320/23350/23380/23410/23440/23470/23500/23530/23560/23590/23620/23650/23680/23710/23740/23770/23800/23830/23860/23890/23920/23950/23980/24010/24040/24070/24100/24130/24160/24190/24220/24250/24280/24310/24340/24370/24400/24430/24460/24490/24520/24550/24580/24610/24640/24670/24700/24730/24760/24790/24820/24850/24880/24910/24940/24970/24990/25020/25050/25080/25110/25140/25170/25200/25230/25260/25290/25320/25350/25380/25410/25440/25470/25500/25530/25560/25590/25620/25650/25680/25710/25740/25770/25800/25830/25860/25890/25920/25950/25980/26010/26040/26070/26100/26130/26160/26190/26220/26250/26280/26310/26340/26370/26400/26430/26460/26490/26520/26550/26580/26610/26640/26670/26700/26730/26760/26790/26820/26850/26880/26910/26940/26970/26990/27020/27050/27080/27110/27140/27170/27200/27230/27260/27290/27320/27350/27380/27410/27440/27470/27500/27530/27560/27590/27620/27650/27680/27710/27740/27770/27800/27830/27860/27890/27920/27950/27980/28010/28040/28070/28100/28130/28160/28190/28220/28250/28280/28310/28340/28370/28400/28430/28460/28490/28520/28550/28580/28610/28640/28670/28700/28730/28760/28790/28820/28850/28880/28910/28940/28970/28990/29020/29050/29080/29110/29140/29170/29200/29230/29260/29290/29320/29350/29380/29410/29440/29470/29500/29530/29560/29590/29620/29650/29680/29710/29740/29770/29800/29830/29860/29890/29920/29950/29980/30010/30040/30070/30100/30130/30160/30190/30220/30250/30280/30310/30340/30370/30400/30430/30460/30490/30520/30550/30580/30610/30640/30670/30700/30730/30760/30790/30820/30850/30880/30910/30940/30970/30990/31020/31050/31080/31110/31140/31170/31200/31230/31260/31290/31320/31350/31380/31410/31440/31470/31500/31530/31560/31590/31620/31650/31680/31710/31740/31770/31800/31830/31860/31890/31920/31950/31980/32010/32040/32070/32100/32130/32160/32190/32220/32250/32280/32310/32340/32370/32400/32430/32460/32490/32520/32550/32580/32610/32640/32670/32700/32730/32760/32790/32820/32850/32880/32910/32940/32970/32990/33020/33050/33080/33110/33140/33170/33200/33230/33260/33290/33320/33350/33380/33410/33440/33470/33500/33530/33560/33590/33620/33650/33680/33710/33740/33770/33800/33830/33860/33890/33920/33950/33980/34010/34040/34070/34100/34130/34160/34190/34220/34250/34280/34310/34340/34370/34400/34430/34460/34490/34520/34550/34580/34610/34640/34670/34700/34730/34760/34790/34820/34850/34880/34910/34940/34970/34990/35020/35050/35080/35110/35140/35170/35200/35230/35260/35290/35320/35350/35380/35410/35440/35470/35500/35530/35560/35590/35620/35650/35680/35710/35740/35770/35800/35830/35860/35890/35920/35950/35980/36010/36040/36070/36100/36130/36160/36190/36220/36250/36280/36310/36340/36370/36400/36430/36460/36490/36520/36550/36580/36610/36640/36670/36700/36730/36760/36790/36820/36850/36880/36910/36940/36970/36990/37020/37050/37080/37110/37140/37170/37200/37230/37260/37290/37320/37350/37380/37410/37440/37470/37500/37530/37560/37590/37620/37650/37680/37710/37740/37770/37800/37830/37860/37890/37920/37950/37980/38010/38040/38070/38100/38130/38160/38190/38220/38250/38280/38310/38340/38370/38400/38430/38460/38490/38520/38550/38580/38610/38640/38670/38700/38730/38760/38790/38820/38850/38880/38910/38940/38970/38990/39020/39050/39080/39110/39140/39170/39200/39230/39260/39290/39320/39350/39380/39410/39440/39470/39500/39530/39560/39590/39620/39650/39680/39710/39740/39770/39800/39830/39860/39890/39920/39950/39980/40010/40040/40070/40100/40130/40160/40190/40220/40250/40280/40310/40340/40370/40400/40430/40460/40490/40520/40550/40580/40610/40640/40670/40700/40730/40760/40790/40820/40850/40880/40910/40940/40970/40990/41020/41050/41080/41110/41140/41170/41200/41230/41260/41290/41320/41350/41380/41410/41440/41470/41500/41530/41560/41590/41620/41650/41680/41710/41740/41770/41800/41830/41860/41890/41920/41950/41980/42010/42040/42070/42100/42130/42160/42190/42220/42250/42280/42310/42340/42370/42400/42430/42460/42490/42520/42550/42580/42610/42640/42670/42700/42730/42760/42790/42820/42850/42880/42910/42940/42970/42990/43020/43050/43080/43110/43140/43170/43200/43230/43260/43290/43320/43350/43380/43410/43440/43470/43500/43530/43560/43590/43620/43650/43680/43710/43740/43770/43800/43830/43860/43890/43920/43950/43980/44010/44040/44070/44100/44130/44160/44190/44220/44250/44280/44310/44340/44370/44400/44430/44460/44490/44520/44550/44580/44610/44640/44670/44700/44730/44760/44790/44820/44850/44880/44910/44940/44970/44990/45020/45050/45080/45110/45140/45170/45200/45230/45260/45290/45320/45350/45380/45410/45440/45470/45500/45530/45560/45590/45620/45650/45680/45710/45740/45770/45800/45830/45860/45890/45920/45950/45980/46010/46040/46070/46100/46130/46160/46190/46220/46250/46280/46310/46340/46370/46400/46430/46460/46490/46520/46550/46580/46610/46640/46670/46700/46730/46760/46790/46820/46850/46880/46910/46940/46970/46990/47020/47050/47080/47110/47140/47170/47200/47230/47260/47290/47320/47350/47380/47410/47440/47470/47500/47530/47560/47590/47620/47650/47680/47710/47740/47770/47800/47830/47860/47890/47920/47950/47980/48010/48040/48070/48100/48130/48160/48190/48220/48250/48280/48310/48340/48370/48400/48430/48460/48490/48520/48550/48580/48610/48640/48670/48700/48730/48760/48790/48820/48850/48880/48910/48940/48970/48990/49020/49050/49080/49110/49140/49170/49200/49230/49260/49290/49320/49350/49380/49410/49440/49470/49500/49530/49560/49590/49620/49650/49680/49710/49740/49770/49800/49830/49860/49890/49920/49950/49980/50010/50040/50070/50100/50130/50160/50190/50220/50250/50280/50310/50340/50370/50400/50430/50460/50490/50520/50550/50580/50610/50640/50670/50700/50730/50760/50790/50820/50850/50880/50910/50940/50970/50990/51020/51050/51080/51110/51140/51170/51200/51230/51260/51290/51320/51350/51380/51410/51440/51470/51500/51530/51560/51590/51620/51650/51680/51710/51740/51770/51800/51830/51860/51890/51920/51950/51980/52010/52040/52070/52100/52130/52160/52190/52220/52250/52280/52310/52340/52370/52400/52430/52460/52490/52520/52550/52580/52610/52640/52670/52700/52730/52760/52790/52820/52850/52880/52910/52940/52970/52990/53020/53050/53080/53110/53140/53170/53200/53230/53260/53290/53320/53350/53380/53410/53440/53470/53500/53530/53560/53590/53620/53650/53680/53710/53740/53770/53800/53830/53860/53890/53920/53950/53980/54010/54040/54070/54100/54130/54160/54190/54220/54250/54280/54310/54340/54370/54400/54430/54460/54490/54520/54550/54580/54610/54640/54670/54700/54730/54760/54790/54820/54850/54880/54910/54940/54970/54990/55020/55050/55080/55110/55140/55170/55200/55230/55260/55290/55320/55350/55380/55410/55440/55470/55500/55530/55560/55590/55620/55650/55680/55710/55740/55770/55800/55830/55860/55890/5



(式中、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は前記と同様である。)

で表わされる化合物と一般式



(式中、R<sup>4</sup>は前記と同様であり、R<sup>5</sup>は低級アルキル基を示す。)

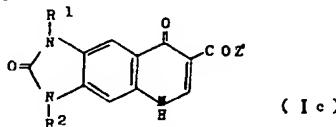
で表わされる化合物とを反応させることにより製造させる。

反応は、一般式(I)および(II)の化合物を好ましくはそれぞれ等モルずつ用いて適当な不活性溶媒(ベンゼン、トルエン、キシレン、メタノール、エタノール、アセトン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドまたはジメチルスルホキサイドなど)の存在下または無溶媒下に室温から150℃、好ましくは90~130℃で加熱することにより得られる。

は低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシアルキル基、アラルキル基または  
-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-C(OR<sup>4</sup>)<sub>2</sub> (nおよびR<sup>4</sup>は前記と同様である)で表わされる基を、Zは水酸基または-OR<sup>4</sup>基 (R<sup>4</sup>は前記と同様である)を示す。)

で表わされる化合物の場合：

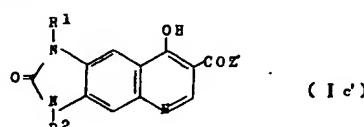
一般式



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびZは前記と同様である)

で表わされる化合物またはその互変異性体である

一般式

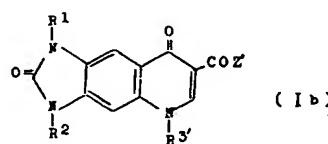


(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびZは前記と同様である。)

ルアセトアミドまたはジメチルスルホキサイドなどの存在下または無溶媒下に室温から150℃、好ましくは90~130℃で加熱することにより得られる。

このようにして得られた一般式(II)の化合物は単離精製することなく、連続して次の加熱閉環工程に用いることもできる。

(2) R<sup>3</sup>が低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシアルキル基、アラルキル基または-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-C(OR<sup>4</sup>)<sub>2</sub> で表わされる基を示し、Zが水酸基または-OR<sup>4</sup>基を示す化合物、すなわち



(式中、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は前記と同様であり、R<sup>3</sup>

で表わされる化合物と一般式



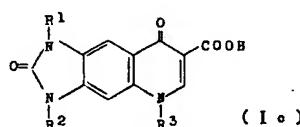
(式中、R<sup>5'</sup>は前記と同様であり、Xは反応活性な原子または基(塩素、臭素、またはヨウ素などのハログン原子、メシリオキシ、ベンゼンスルホニルオキシまたはトリルオキシなどのスルホニルオキシ基または-OR<sub>2</sub>O<sub>2</sub>OR<sup>3'</sup>基を示す。)

反応は適当な溶媒(水、メタノール、エタノール、ブタノール、ベンゼン、トルエン、キシレン、アセトン、ジオキサン、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドまたはジメチルスルホキサイドなど)中またはこれらの混合溶媒中、有利には脱酸剤(水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、

カリクムブトキサイド、トリエチルアミンまたはピリジンなど)の存在下、30~120℃で、必要であれば耐圧装置を用いて進行する。

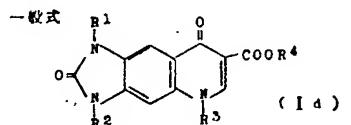
出発物質の一般式(Ib)または(Ic)の化合物は、Zが-OR<sup>4</sup>基を示す場合は方法(I)Cにより、またZが水酸基を示す場合は後述する方法(3)Cによりそれぞれ製造される。

(3)Zが水酸基を示す化合物、すなわち、一般式



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は前記と同様である。)

で表わされる化合物の場合:



れる。

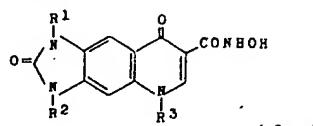
(4)一般式(Id)の化合物は、方法(I)または方法(2)Cにより製造されるが、さらに一般式(Ia)の化合物と一般式



(式中、R<sup>4</sup>は前記と同様である。)

で表わされる化合物またはその水酸基における反応性誘導体と常法によつて反応させることによつても製造される。

(5)Zがヒドロキシアミノ基を示す化合物、すなわち、一般式



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は前記と同様である。)

(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は前記と同

様である。)

て表わされる化合物を加水分解反応に付すことにより製造される。

反応は、水単独または水およびメタノール、エタノール、アセトン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドまたはジメチルスルホキサイドとの混合溶媒中無機酸(塩酸、硫酸またはリン酸など)またはアルカリ(水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウムまたは炭酸水素カリウムなど)を用いて、50~150℃、好ましくは100℃付近で進行する。

出発物質の一般式(Id)の化合物のうち、R<sup>3</sup>が水素原子の化合物は方法(I)により、R<sup>3</sup>が水素原子以外の基を示す化合物は方法(2)により製造さ

て表わされる化合物の場合:

一般式(Id)の化合物およびそのカルボキシル基における反応性誘導体(一般式(Id))で表わされる化合物も含む)とヒドロキシリルアミンとを反応させることにより得られる。

一般式(Id)の化合物とヒドロキシリルアミンとの反応は、化合物(Id)を適当な不活性溶媒(メタノール、エタノール、ブタノール、アセトン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドまたはピリジンなど)中またはそれらの混合溶媒中に溶かした溶液に、-20~150℃で、ヒドロキシリルアミン塩酸塩およびアルカリ(水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、ナトリウムメトキサイド、カリクムメトキサイド、炭酸ナトリウムまたは炭酸カリウムなど)から、

適当な溶媒（水、メタノール、エタノール、アセトン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキサイドまたはピリジンなど、好ましくはメタノール）中またはそれらの混合溶媒中、10～60℃にて調整したヒドロキシルアミン溶液を加えることにより進行する。

以上のようにして得られる一般式（I）の化合物は、所望により無機塩（塩酸、硫酸、臭化水素酸または硝酸など）または有機酸（シク酸、マレイン酸、スマール酸、クエン酸、メタンスルホン酸またはp-トルエンスルホン酸など）と処理することにより酸付加塩となしるし、また、Zが水酸基およびヒドロキシアミノ基である化合物は、常法によりそれぞれアルカリ金属（ナトリウム、カリウムまたはリチウムなど）塩およびアル

カリ土系金属（カルシウムまたはマグネシウムなど）塩となしる。

本発明の化合物（I）およびその医薬的に許容しうる塩は抗菌作用を有し、およびマックス白血病（L-1210）、吉田肉腫またはエールリツヒ腹水癌などにすぐれた効果を示し、抗凝剤または制癌剤として有用である。

本発明の化合物（I）およびその医薬的に許容しうる塩を医薬として用いる場合、それ自体または適宜の薬理的に許容される担体、賦形剤、希釈剤と混合し、粉末、顆粒、錠剤、カプセル剤、注射剤などの形態で、経口的または非経口的に投与することができる。投与量は対象疾患、症状、化合物によつても異なるが、経口投与の場合通常成人1日あたり、300～3000mg程度である。

以下、実施例により本発明をより詳細に説明する。

#### 実施例1

Z-(1,3-ジメチル-1,2-ジヒドロ-2-オキソ-5-ベンズイミダゾリル)アミノメチレンマロン酸ジエチルエステル 1.5g を 240℃にて加熱したサームS（登録商標、新日鉄化学製）90mlに投入する。30分間245℃で加熱攪拌後、室温まで冷却し結晶を採取してメタノールで充分洗う。ジメチルホルムアミドで再結晶すると、黄褐色結晶の1,3-ジメチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエステルが得られる。融点320℃以上。

核磁気共鳴スペクトル（100MHz, 酢酸中）

1.60 ppm (3H) トリプレット

3.15 ppm (6H) ダブルレット

4.73 ppm (2H) カルテット

7.86 ppm (1H) シングルレット

8.18 ppm (1H) シングルレット

9.28 ppm (1H) ダブルレット  
赤外線吸収スペクトル（臭化カリウム盤）

1728 cm<sup>-1</sup> → C=O (エステル部)

1720 cm<sup>-1</sup> → C=O (環)

同様にして次の化合物が得られる。

◎Z-(1,3-ジベンジル-1,2-ジヒドロ-2-オキソ-5-ベンズイミダゾリル)アミノメチレンマロン酸ジエチルエ斯特ルから、1,3-ジベンジル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ル 融点271

◎ヨー-(1-ベンジル-1,3-ジヒドロ-2-

オキソ-5-ベンズイミダゾリル)アミノメチレンマロン酸ジエチルエステルから、1-ベンジル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ル 融点292~295°C(分解)

◎ヨー-(1,2-ジヒドロ-2-オキソ-5-ベンズイミダゾリル)アミノメチレンマロン酸ジエチルエ斯特ルから、1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ル 融点320°C以上

## 実施例2

5-アミノ-1,3-ブチル-1,2-ジヒドロ-2-オキソベンズイミダゾール23gおよび

炭酸ナトリウム26.5g、ヨク化エチル16.8gおよびジメチルホルムアミド600gの混合液を85°Cで8時間加熱攪拌し、さらに120°Cで3時間加熱する。反応終了後、熱時戻して不溶物を除去し、液を半分まで減圧濃縮する。20°Cまで冷却してから冰水2Lに投入し結晶をよく降り取る。水洗後エタノールで再結晶すると、淡黄色の1,3-ジメチル-5-エチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ルが得られる。融点231~234°C

-以下余白-

エトキシメチレンマロン酸ジエチルエ斯特ル2L

6gを130°Cで3時間加熱後、副生したエタノールを減圧下に留去する。

生成した褐色油状物質を、240°Cに加熱したナーム8(登録商標、新日鐵化学製)に投入し、30分間245°Cで加熱攪拌する。

析出した結晶を室温まで冷却した後、戻取し、メタノールで洗つて洗浄すると、黄褐色結晶の1,3-ジブチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ルが得られる。融点268~271°C(分解)

## 実施例3

1,3-ジメチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ル60g,

れる。融点231~234°C

1行削除

同様にして、以下の化合物が得られる。

◎5-アリル-1,3-ジメチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ル 融点230~232°C(エタノールから)

◎1,3-ジメチル-5-(2-エトキシエチル)-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ル 融点231~232°C(エタノールから)

◎1,3-ジメチル-5-イソプロピル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ル

## 実施例4

ジメチルホルムアミド 9.0 ml C1, 3-ジメチル-1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエステル 6.0 g を懸濁し、10℃で水素化ナトリウム 1.1 g を一度に加える。室温で1時間攪拌後、温度を徐々に上げ、90℃で透明液となるまで攪拌する。冷後、20℃にてテトラヒドロフルフリルプロマイド 5.0 g を加え、室温にて10時間攪拌する。副生する臭化ナトリウムを戻し、沪液を減圧下に濃縮し、得られた結晶を水でよく洗う。エタノールから再結晶すると、1, 3-ジメチル-5-エチル-1, 2, 5, 8-テトラヒドロフルフリル-1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ルが得られる。融点 209~211℃

## 実施例 5

1, 3-ジブチル-1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ル 1.5 g, 炭酸カリウム 9.4 g, ヨク化エチル 1.4 g, ジメチルホルムアミド 11.5 ml および水 11.5 ml の混合溶液を 85℃に 3 時間、105℃で 2 時間加熱攪拌を行なう。反応終了後、溶媒を減圧下に留去する。残った糊状物質を充分冷却した後、冰水 300 ml に投入し、クロロホルムで抽出する。硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮乾固し、得られた粗結晶を酢酸エチルから再結晶すると、1, 3-ジブチル-5-エチル-1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ルが得られる。融点 157~158℃

同様にして、次の化合物が得られる。

④ 5-ペンジル-1, 3-ジメチル-1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ル、融点 239~241℃(エタノールから)

⑤ 1, 3-ジベンジル-5-エチル-1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ル 融点 200~203℃(エタノールから)

⑥ 1, 3-ジメチル-5-(2, 3-エボキシプロピル)-1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ル

1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ斯特ル 1.0 g を 1.0% 水素化ナトリウム水溶液 300 ml に懸濁し 3 時間還流する。熱時、不溶物を戻し、冷後粗酸で酸性にして析出する結晶を戻す。充分に水洗後乾燥し、ジメチルホルムアミドから再結すると、1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸が得られる。融点 320℃以上

同様にして次の化合物が得られる。

⑦ 1, 3-ジメチル-1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸 融点 320℃以上(ジメチルホルムアミドから)

⑧ 1, 3-ジメチル-5-エチル-1, 2, 5,

## 実施例 6

8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸 融点

320°C以上(ジメチルホルムアミドから)

核磁気共鳴スペクトル(100MHz, トリフルオロ  
酢酸中)

1.60 ppm (3H) トリプレット

1.84 ppm (3H) トリプレット

1.71 ppm (6H) ダブルレット

4.72 ppm (2H) カルテット

5.00 ppm (2H) カルテット

7.90 ppm (1H) シングルレット

8.38 ppm (1H) シングルレット

9.29 ppm (1H) シングルレット

赤外線吸収スペクトル(臭化カリウム板)

1726cm<sup>-1</sup> > C=O (エステル部)

1709cm<sup>-1</sup> > C=O (環)

④ 1,3-ジメチル-5-(2-エトキシエチル

)-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジ

オキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カ

ルボン酸 融点277~280°C(ジメチルホル

ムアミドから)

⑤ 5-ベンジル-1,3-ジメチル-1,2,5

,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ

[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸 融点

290~291°C(分解)(ジメチルホルムアミ  
ドから)

⑥ 1,3-ジメチル-5-テトラヒドロフルシリ

ル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジ

オキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カ

ルボン酸 融点320°C以上(ジメチルホルムア

ミドから)

⑦ 1,3-ジベンジル-5-エチル-1,2,5

,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ

[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸 融点

262~263°C(ジメチルホルムアミドから)

⑧ 1,3-ジメチル-5-(2,3-エポキシブ

ロビル)-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,

8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7

-カルボン酸

⑨ 1,3-ジメチル-5-(3-テトラヒドロフ

リル)-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8

ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7

-カルボン酸

⑩ 1,3-ジメチル-5-(2-テトラヒドロビ

ラニル)-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,

8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸

⑪ 1,3-ジメチル-5-(2-テトラヒドロビ

ラニルメチル)-1,2,5,8-テトラヒドロ

-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノ

リン-7-カルボン酸

⑫ 1,3-ジメチル-5-(2,4-ジクロロベ

ンジル)-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,

8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7

-カルボン酸

⑬ 1,3-ジメチル-5-(4-ニトロベンジル

-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジ

オキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カ

ルボン酸

⑭ 5-(4-クロロベンジル)-1,3-ジメチ

ル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジ

オキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カ

4015-3-50197(3)

ルボン酸

⑤-ブチル-1, 3-ジメチル-1, 2, 5,

⑥5-(3, 4-ジメトキシベンジル)-1, 3-

8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ[

-ジメチル-1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2,

4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸

, 8-ジオキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-

2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイ

-7-カルボン酸

ミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸

⑦1, 3-ジメチル-5-(4-メチルベンジル)-

1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジ

オキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カル

ボン酸

ルボン酸

⑧5-(2-ブトキシエチル)-1, 3-ジメチ

ル-1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジ

オキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カ

ルボン酸

ルボン酸

⑨1, 3-ジメチル-5-ビニル-1, 2, 5,

8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ[

4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸

4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸

⑩1, 3-ジメチル-5-イソプロピル-1, 2,

1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイ

ミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸

ルボン酸

イミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン

5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダ

酸

ゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸

⑪1, 3-ジメチル-5-(2-エチルヘキシル)-

-以下余白-

)-1, 2, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジ

オキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カ

ルボン酸

⑫1, 3-ジメチル-5-オクチル-1, 2, 5,

, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ

[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸

⑬1, 3-ジメチル-5-ラクリル-1, 2, 5,

, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミダゾ

[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸

⑭1, 3-ジメチル-5-ヘキサデシル-1, 2,

, 5, 8-テトラヒドロ-2, 8-ジオキソイミ

ダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カルボン酸

⑮1, 3-ジメチル-5-ステアリル-1, 2,

### 実施例 7

1 , 3 -ジメチル -1 , 2 , 5 , 8 -テトラヒドロ -2 , 8 -ジオキソイミダゾ [ 4 , 5 -g ] キノリン -7 -カルボン酸 1.8 g を 6 % 水酸化ナトリウム水溶液 10 mL に溶かし、搅拌しながら 80 ℃ にてジメチル硫酸 4.4 g をゆっくり滴下する。水酸化ナトリウム 1.6 g を加え、さらにジメチル硫酸 4.4 g を滴下する。これをさらに 2 回繰り返し、冷後成色灰を加えて戻過する。戻液を塩酸酸性にして析出する結晶を戻取する。水でよく洗浄後、乾燥し、ジメチルホルムアミドから再結晶すると、1 , 3 , 5 -トリメチル -1 , 2 , 5 , 8 -テトラヒドロ -2 , 8 -ジオキソイミダゾ [ 4 , 5 -g ] キノリン -7 -カルボン酸が得られる。

融点 320 ℃ 以上

### 実施例 8

1 -テトラヒドロ -2 , 8 -ジオキソイミダゾ [ 4 , 5 -g ] キノリン -7 -カルボン酸 3.0 g および水酸化カリウム 0.56 g を水 100 mL に溶解する。減圧下に水を留去し得られたカリウム塩結晶を 150 ℃ / 0.1 mmHg で減圧乾燥する。これをジメチルスルホキサイド 50 mL に懸濁し、炭酸水素カリウム 100 g およびメトキシエチルクロライド 2.0 g を加えて 110 ℃ で 3 時間加熱搅拌する。得られた透明液を 10 ℃ で冷却し冰水 200 mL に投入する。析出する結晶を戻取し、水洗後、乾燥し、ジオキサンから再結晶すると、無色の 1 , 3 -ジメチル -5 -エチル -1 , 2 , 5 , 8 -テトラヒドロ -2 , 8 -ジオキソイミダゾ [ 4 , 5 -g ] キノリン -7 -カルボン酸 2 -メトキシエチルエステルが得られる。融点 166 ~ 169 ℃

同様にして次の化合物が得られる。

融点 (JP) -50197.10)

1 -ベンジル -2 , 3 , 5 , 8 -テトラヒドロ

-2 , 8 -ジオキソイミダゾ [ 4 , 5 -g ] キノ

リン -7 -カルボン酸エチルエステル 2.8 g を 4

% 水酸化ナトリウム 50 mL と 3 時間加熱還流する。

得られた溶液に 80 ℃ でジエチル硫酸 1.9 g を滴

下する。さらに 4 % 水酸化ナトリウム 1.5 g を加

え、ジエチル硫酸 1.9 g を滴下する。これをさら

に 2 回繰り返した後、脱色炭を加え戻過する。戻

液を冷後、塩酸酸性にして析出する結晶を戻取し

乾燥する。メチルセルソルブから再結晶すると、

1 -ベンジル -3 , 5 -ジエチル -1 , 2 , 5 ,

8 -テトラヒドロ -2 , 8 -ジオキソイミダゾ [

4 , 5 -g ] キノリン -7 -カルボン酸が得られ

る。融点 271 ~ 273 ℃

### 実施例 9

1 , 3 -ジメチル -5 -エチル -1 , 2 , 5 , 8

1 -テトラヒドロ -2 , 8 -ジオキソイミダゾ [

4 , 5 -g ] キノリン -7 -カルボン酸メチルエ

ステル 融点 265 ~ 267 ℃ (メタノールから)

② 1 , 3 -ジメチル -5 -エチル -1 , 2 , 5 ,

8 -テトラヒドロ -2 , 8 -ジオキソイミダゾ [

4 , 5 -g ] キノリン -7 -カルボン酸テトラヒ

ドロフルフリルエステル 融点 156 ~ 159 ℃

(ジオキサン - ベンゼンから)

③ 1 , 3 -ジメチル -5 -エチル -1 , 2 , 5 ,

8 -テトラヒドロ -2 , 8 -ジオキソイミダゾ [

4 , 5 -g ] キノリン -7 -カルボン酸フェニル

エステル

④ 1 , 3 -ジメチル -5 -エチル -1 , 2 , 5 ,

8 -テトラヒドロ -2 , 8 -ジオキソイミダゾ [

4 , 5 -g ] キノリン -7 -カルボン酸メニト

## ロフエニルエステル

◎ 1,3-ジメチル-5-エチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸ベンジル

## エステル

◎ 1,3-ジメチル-5-エチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸2,3-

## エボキシプロビルエステル

◎ 1,3-ジメチル-5-エチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸ブチルエ

## ステル

◎ 1,3-ジメチル-5-エチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸アリルエ

キシリルアミンのメタノール溶液を攪拌しながらゆっくり滴下する。滴下後、温度を徐々に上げていくと60℃で液は一度透明になり、ただちに結晶が析出してくる。60℃にて3時間攪拌した後、10℃まで冷却して、結晶を採取する。メタノールでよく洗つた後、冰水に投入し酢酸鉄性とする。ヒドロキサム酸が析出する。これを採取してメタノールで洗浄後、乾燥する。ジメチルホルムアミドから再結晶すると、無色の1,3-ジメチル-5-エチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸が得られる。融点252~253℃(分解)。

同様にして次の化合物が得られる。

◎ 1,3-ジメチル-5-アリル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-

## ステル

◎ 1,3-ジメチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸2-テトラヒドロビ

## ラニルメチルエステル

## 実施例10

ヒドロキシリルアミン塩酸塩7.2gをメタノール50mlに溶解し10℃以下に冷却してこれに氷酸化カリウム8.5gをメタノール100mlに溶かし、水浴液をゆっくり滴下する。副生する塩化カリウムを戻去してヒドロキシリルアミンのメタノール溶液を調製する。1,3-ジメチル-5-エチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエステル17.7gをメタノール150mlに溶解し、20℃以下で先に調製したヒドロ

4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

◎ 1,3-ジメチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

◎ 1,3-ジメチル-5-ビニル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

◎ 5-ブチル-1,3-ジメチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

◎ 1,3,5-トリメチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

◎ 5-イソブチル-1,3-ジメチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑤ 1,3-ジメチル-5-エトキシメチル-1,

2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑥ 1,3-ジメチル-5-(2-ブトキシエチル)-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑦ 1,3-ジメチル-5-(2-メトキシエチル)-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑧ 1,3-ジメチル-5-(2-テトラヒドロピラニル)-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑨ 1,3-ジメチル-5-テトラヒドロフルフ

-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑩ 1,3-ジエチル-5-メチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑪ 1,3,5-トリエチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑫ 1,3-ジエチル-5-(2-テトラヒドロフルル)-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑬ 1,3-ジブチル-5-エチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

リル-1,2,5,8-テトラヒドロフルフル

-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑭ 1,3-ジメチル-5-(2-テトラヒドロピラニルメチル)-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑮ 5-ベンジル-1,3-ジメチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑯ 5-(2,4-ジクロロベンジル)-1,3-ジメチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑰ 1,3-ジメチル-5(2-ニトロベンジル)

⑱ 1,3-ジブチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑲ 1,3-ジイソブチル-5-エチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

⑳ 1,3-ジベンジル-5-メチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

㉑ 1,3-ジベンジル-5-エチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

㉒ 5-(2-ブテニル)-1,3-ジメチル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

## 手 続 極 正 書(自記)

昭和51年10月24日

特許庁 長官 黑谷 喜二殿

◎ 1,3-ジメチル-5-(2-エチルヘキシ

ル)-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-

ジオキソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-

ヒドロキサム酸

◎ 1,3-ジメチル-5-オクチル-1,2,

5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダ

ゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

◎ 1,3-ジメチル-5-ラクチル-1,2,

5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダ

ゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

◎ 1,3-ジメチル-5-ステアリル-1,2,

5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダ

ゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

◎ 1,3-ジメチル-5-ヘキサデシル-1,

2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイ

ミダゾ[4,5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

代理人 弁理士 高宮城 謙

## 6. 極正の内容

明細書を以下の通り極正する。

(1) 第21ページ下から2行の「チルエステル」の  
後に「融点288~290℃」を挿入する。(2) 第24ページ下から2行と末行の間に以下の記  
載を挿入する。◎ 5-エチル-1,3-ジメチル-1,2,5,  
8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[  
4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエ

ステル 融点198~201℃

◎ 1,3-ジメチル-5-オクチル-1,2,5,  
8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[  
4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチル

エステル 融点161~165℃

◎ 5-(2-ブテンイル)-1,3-ジメチル-1,  
2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソ

イミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン

酸エチルエステル 融点205~208℃

◎ 1,3-ジメチル-5-ステアリル-1,2,  
5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダ  
ゾ[4,5-g]キノリン-7-カルボン酸エチ  
ルエステル 融点149~151℃◎ 1,3,5-トリメチル-1,2,5,8-テ  
トラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4,5  
-g]キノリン-7-カルボン酸エチルエステル  
融点279~282℃◎ 1,3-ジメチル-5-(2-メチルアリル)  
-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオ  
キソイミダゾ[4,5-g]キノリン-7-カル  
ボン酸エチルエステル 融点228~230℃◎ 1,3-ジメチル-5-(1-メチルアリル)  
-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオ

キソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カル

ポン酸エチルエステル 融点184~187°C

⑤5-(4-クロロベンジル)-1,3-ジメチ

ル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジ

オキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カ

ルポン酸エチルエステル 融点120~123°C

⑥5-(2-エチルヘキシル)-1,3-ジメチ

ル-1,2,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジ

オキソイミダゾ[4, 5-g]キノリン-7-カ

ルポン酸エチルエステル 融点160.5~162

5°C

(3)第30ページ2行の「ルポン酸」の後に「融点

326~327°C(分解)」を挿入する。

(4)第30ページ下から4行の「[4, 5-g]キノ

リン-7-カルポン酸」の後に「融点320°C以

上」を挿入する。

(5)第31ページ3行の「[4, 5-g]キノリン-

-7-カルポン酸」の後に「融点280~282°C

」を挿入する。

(6)第32ページ2行の「酸」の後に「融点30.8

~31.1°C(分解)」を挿入する。

(7)第32ページ6行の「ルポン酸」の後に「融点

222~224°C」を挿入する。

(8)第32ページ9行の「[4, 5-g]キノリン-

-7-カルポン酸」の後に「融点212~214

°C」を挿入する。

(9)第41ページ1行の「[4, 5-g]キノリン-

-7-ヒドロキサム酸」の後に「融点246~24

9°C(分解)」を挿入する。

20第41ページ1行の「[4, 5-g]キノリン-

-7-ヒドロキサム酸」の後に「融点249~25

1°C(分解)」を挿入する。

(11)第41ページ10行の「[4, 5-g]キノリン

-7-ヒドロキサム酸」の後に「融点246~2

49°C(分解)」を挿入する。

(12)第43ページ11行と12行の間に「融点24

9~252°C(分解)」を挿入する。

(13)第45ページ末行の「キサム酸」の後に「融点

249~252°C(分解)」を挿入する。

(14)第46ページ1行の「ヒドロキサム酸」の後に

「融点238~241°C(分解)」を挿入する。

(15)第46ページ7行と8行の間に「融点217~

219°C(分解)」を挿入する。

(16)第46ページ下から5行と6行の間に「融点1

58~162°C」を挿入する。

(17)第46ページ下から2行と末行の間に以下の記

載を挿入する。

「①1,3-ジメチル-1,2,5,8-テトラヒ

ドロ-2,8-ジオキソイミダゾ[4, 5-g]

キノリン-7-ヒドロキサム酸 融点343~3

46°C(分解)

②1,3-ジメチル-5-イソプロピル-1,2

,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミ

ダゾ[4, 5-g]キノリン-7-ヒドロキサム

酸 融点233~234°C(分解)

③5-フルオル-1,3-ジメチル-1,2

,5,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミ

ダゾ[4, 5-g]キノリン-7-ヒドロキサム

酸 融点167~170°C

④5-グラニル-1,3-ジメチル-1,2,5

,8-テトラヒドロ-2,8-ジオキソイミダゾ

[4, 5-g]キノリン-7-ヒドロキサム酸

融点186~190°C

⑤1,3-ジメチル-5-プロペニル-1,2,

5 , 8 - テトラヒドロ - 2 , 8 - ジオキソイミダゾ [ 4 , 5 - g ] キノリン - 7 - ヒドロキサム酸  
融点 305 ~ 306°C (分解)  
◎ 5 - ( 4 - クロロベンジル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 , 2 , 5 , 8 - テトラヒドロ - 2 , 8 - ジオキソイミダゾ [ 4 , 5 - g ] キノリン - 7 - ヒドロキサム酸 融点 196 ~ 199°C (分解)  
◎ 1 , 3 - ジメチル - 5 - ( 2 - メチルアリル ) - 1 , 2 , 5 , 8 - テトラヒドロ - 2 , 8 - ジオキソイミダゾ [ 4 , 5 - g ] キノリン - 7 - ヒドロキサム酸 融点 234 ~ 237°C (分解)  
◎ 5 - エチル - 1 , 3 - ジメチル - 1 , 2 , 5 , 8 - テトラヒドロ - 2 , 8 - ジオキソイミダゾ [ 4 , 5 - g ] キノリン - 7 - ヒドロキサム酸 カリウム 融点 199 ~ 202°C (分解)

特許第53-50197(13)  
手 続 补 正 書(自発)

昭和 52 年 10 月 26 日

特許庁 長官 黑谷 善二 殿

1. 事件の表示

昭和 51 年 特許願第 123626 号

2. 発明の名称

イミダゾキノリン誘導体

3. 补正をする者

事件との関係 特許出願人  
住 所 大阪市東区平野町 3 丁目 35 番地  
名 称 吉富製薬株式会社  
(6 7 2) 代表者 田坂 元祐

4. 代理人

住 所 大阪市東区平野町 3 丁目 35 番地  
吉富製薬株式会社内  
氏 名 弁理士 高宮城 勝  
(6 6 3 0)



5. 补正の対象

明細書の発明の詳細な説明の箇

6. 补正の内容

明細書(昭和 52 年 10 月 24 日付手続補正) 書  
子欄

より補正されたもの)を以下の通り補正する。

- (1) 前記補正書第 2 ページ第 1 行の「エチル」を「ブチル」に訂正する。
- (2) 同第 1 ページ末行の「5 - プロペニル」を「5 - ( 1 - プロペニル )」に訂正する。

以 上